

УД-19

РЕАКЦИЯ ПААЛЯ – КНОРРА – ЭФФЕКТИВНЫЙ МЕТОД СИНТЕЗА
1,2-АННЕЛИРОВАННЫХ ПИРРОЛОВ

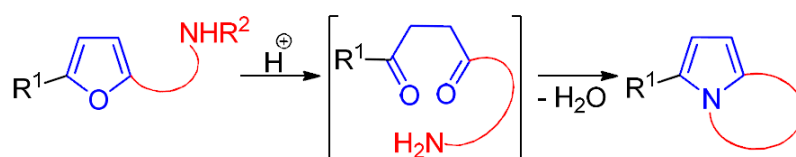
М. Г. Учускин

Пермский государственный национальный исследовательский университет
614990, г. Пермь, ул. Букирева, 15.

E-mail: mu@psu.ru

Разнообразные виды биологической активности 1,2-аннелированных пирролов предоставляют прекрасную возможность для поиска и разработки современных лекарственных средств на основе этих азагетероциклических каркасов. Однако прогресс в данном направлении остается достаточно медленным, что связано, в первую очередь, со сложностью синтеза целевых продуктов. Описанные синтетические подходы к 1,2-аннелированным пирролам обычно основаны на многостадийной последовательности реакций. Одним из перспективных методов построения 1,2-аннелированного пиррольного каркаса, на наш взгляд, является внутримолекулярная реакция Пааля – Кнорра, которая заключается во взаимодействии подходяще расположенной аминогруппы с 1,4-дикарбонильным фрагментом. Такой подход позволяет одновременно сформировать оба гетероциклических кольца и за минимальное количество синтетических стадий максимально усложнить структуру образующихся продуктов.

На протяжении последних лет нашей научной группой разрабатываются общие подходы к получению широкого набора гетероциклических соединений. В основу проводимых исследований положена многогранная реакционная способность фуранового ядра, которая позволяет вовлекать замещенные фураны в превращения, характерные для активированных олефинов, 1,3-диенов, 1,4-дикетонов и др.^{1,2} В частности, нами разработана серия методов синтеза разнообразных 1,2-аннелированных пирролов, при этом особенность разработанных процессов заключается в использовании замещенных фуранов в качестве скрытых источников 1,4-дикарбонильных соединений.



В докладе будут рассмотрены современные методы построения 1,2-аннелированных пирролов и разработанные нами подходы. При этом особое внимание будет уделено обсуждению особенностей протекания ключевых трансформаций; влияния реакционных условий, стерических и электронных факторов на эффективность реакций рециклизации и выходы целевых продуктов.

Библиографический список

1. Trushkov I. V. Furan's Gambit: Electrophile-Attack-Triggered Sacrifice of Furan Rings for the Intramolecular Construction of Azaheterocycles / Trushkov I. V., Uchuskin M. G., Butin A. V. // European Journal of Organic Chemistry. – 2015. – P. 2999-3016.
2. Abaev V. T. The Butin reaction / Abaev V. T., Trushkov I. V., Uchuskin M. G. // Chemistry of Heterocyclic Compounds. – 2016. – Vol. 52 – P. 973-995.